

12

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

21 Anmeldenummer: 85101520.8

22 Anmeldetag: 13.02.85

51 Int. Cl.⁴: **C 07 D 249/08**

C 07 D 401/06, C 07 D 401/12

C 07 D 403/06, C 07 D 405/12

A 01 N 43/653

30 Priorität: 25.02.84 DE 3406908

40 Veröffentlichungstag der Anmeldung:
04.09.85 Patentblatt 85/36

64 Benannte Vertragsstaaten:
CH DE FR GB IT LI

71 Anmelder: **HOECHST AKTIENGESellschaft**
Postfach 80 03 20
D-6230 Frankfurt am Main 80(DE)

72 Erfinder: **Ehrhardt, Heinz, Dr.**
Bergstrasse 21
D-8901 Rehling(DE)

72 Erfinder: **Mildenberger, Hilmar, Dr.**
Fasanenstrasse 24
D-6233 Kelkheim (Taunus)(DE)

72 Erfinder: **Handt, Reinhard, Dr.**
Theilweg 23
D-8901 Gablingen(DE)

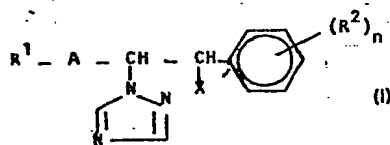
72 Erfinder: **Sachse, Burkhard, Dr.**
An der Ziegelei 30
D-6233 Kelkheim (Taunus)(DE)

72 Erfinder: **Hartz, Peter, Dr.**
An der Ziegelei 28
D-6233 Kelkheim (Taunus)(DE)

72 Erfinder: **Bürsteli, Helmut, Dr.**
Am Hohlaacker 65
D-6000 Frankfurt am Main 50(DE)

54 Neue Triazolylalkylderivate, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Pflanzenbehandlungsmittel.

57 Verbindungen der Formel (I),



Phenyl; R⁸ und R⁹ = Alkanoyl, Benzoyl, Alkoxy-carbonyl oder Cyano bedeuten, sowie deren pflanzen-verträgliche Metall-salzkomplexe, Säureadditionsverbindungen und Quaternie-rungsprodukte besitzen vorteilhafte fungizide und pflanzen-wachstumsregulatorische Wirkung.

worin A = eine Carbonylgruppe oder die Gruppierung
 -CH(OH)-; R¹ = (subst.) Phenyl, (subst.) Alkyl, (subst.)
 Cycloalkyl oder Bicycloalkyl; R² = Halogen, (subst.) Alkyl,
 Cycloalkyl, (subst.) Alkoxy, Alkylthio, Alkenyloxy, Dialkylami-
 no, Nitro, Cyano, Hydroxy, Alkoxy-carbonyl, Phenyl, Phenoxy
 oder zwei Reste R² eine C-Kette; n = 0, 1, 2 oder 3; X =
 -S(O)_mR⁸ (mit m = 0, 1 oder 2), (subst.) Amino, (subst.)
 Piperidino, (subst.) Morpholino, CHR⁸R⁹, (subst.) Triazolyl,
 (subst.) Pyrazolyl, (subst.) Pyrimidinyl; R⁶ = (subst.) Alkyl,
 Alkenyl, Cycloalkyl, Aminoalkyl, Dialkylaminoalkyl, Dicarbo-
 xyalkyl, R¹¹-O-CO-(amino)alkyl, R¹²-S-CO-alkyl;
 (subst.) Amino-CO-Alkyl, Alkanoyl, (subst.) Benzoyl,
 (subst.) Phenyl oder (subst.) Benzyl, Furfuryl oder einen O, S
 oder N-Heterocyclus; R¹¹ = H, (subst.) Alkyl, Cycloalkyl,
 (subst.) Alkenyl, Cycloalkenyl, Alkyl, (subst.) Phenyl, Furfu-
 ry, Tetrahydrofurfuryl oder ein Kationäquivalent einer Base;
 R¹² = Alkyl, (subst.) Phenylalkyl, Alkenyl oder (subst.)

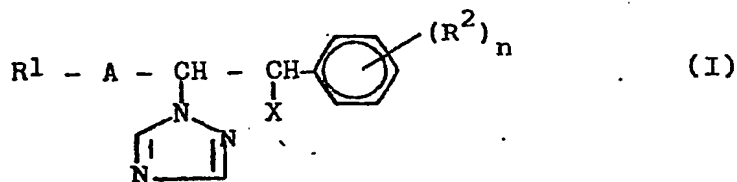
Neue Triazolylalkyllderivate, Verfahren zu ihrer Her-
stellung sowie ihre Verwendung als Pflanzenbehandlungs-
mittel

Es ist bekannt, daß bestimmte Triazolylalkylthioether
(DE-A 31 08 770) fungizide und wuchsregulatorische
Eigenschaften besitzen. Ihre fungizide Wirkung ist je-
doch, insbesondere bei niedrigen Aufwandmengen und
-konzentrationen, nicht voll befriedigend. Auch die
pflanzenwachstumsregulierende Wirkung dieser Azolderivate
ist nicht ausreichend.

Weiterhin ist bekannt, daß bestimmte Bisazolylver-
bindungen (DE-A 32 15 360) als Pflanzenwachstumsregula-
toren wirken. Die Wirkung dieser Azolderivate ist jedoch
ebenfalls, insbesondere bei niedrigen Aufwandmengen und
-konzentrationen, unbefriedigend.

Es wurden nun neue Triazolylalkyllderivate mit interessan-
ten pflanzenwachstumsregulierenden und fungiziden Eigen-
schaften gefunden.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher die Ver-
bindungen der Formel (I),

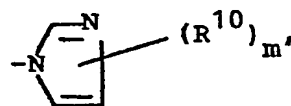
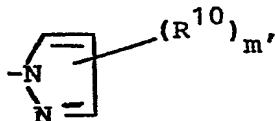
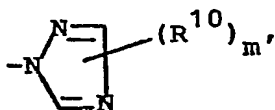


worin

A eine Carbonylgruppe oder die Gruppierung $-\text{CH}(\text{OH})-$

- R¹ Phenyl das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Halogen, Trifluormethyl, NO₂, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkyl und/oder einfach durch Phenyl, Phenoxy oder Halogenphenoxy substituiert ist gegebenfalls durch (C₁-C₄)Alkyl substituiertes Cyclo(C₃-C₇)alkyl oder Bicyclo(C₆-C₁₄)alkyl insbesondere [2.2.1]Bicycloheptyl, oder die Gruppierung -CHR³R⁴, in welcher
- R³ Wasserstoff oder (C₁-C₄)Alkyl, insbesondere Methyl,
- 10 R⁴ Wasserstoff, (C₁-C₃)Alkyl, insbesondere Methyl, Halogen(C₁-C₄)alkyl, Cyclo(C₃-C₆)alkyl, Bicyclo(C₆-C₁₄)alkyl, insbesondere [2.2.1]-Bicycloheptyl, das durch (C₁-C₄)alkyl ein oder mehrfach substituiert sein kann, Phenyl, Halogenphenyl, Phenyl-
- 15 (C₁-C₄)alkyl, Halogenphenyl-(C₁-C₄)alkyl oder (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl,
- R² Halogen, Halogen(C₁-C₄)alkyl oder Halogen(C₁-C₄)-alkoxy mit jeweils bis zu 5 Halogenen, insbesondere Fluor oder Chlor, (C₁-C₆)Alkyl,
- 20 Cyclo(C₅-C₇)alkyl, (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₆)-Alkylthio, (C₂-C₆)Alkenyloxy, Di(C₁-C₆)alkyl-amino, Nitro, Cyano, Hydroxy, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Phenyl, Phenoxy oder im Falle n = 2 können zwei Reste R² zusammen eine gegebenenfalls
- 25 ungesättigte Kohlenwasserstoffkette mit 3 bis 4 C-Atomen bilden, die benachbarte Ringpositionen miteinander verbinden,
- n 0, 1, 2 oder 3, wobei bei Mehrfachsubstitution die Reste R² verschiedene Bedeutungen besitzen können,
- 30 X -S(O)_mR⁵; -NR⁶R⁷, CHR⁸R⁹,

35



wobei

m 0, 1 oder 2

R⁵ (C₁-C₁₂)Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Hydroxy, Halogen oder (C₁-C₄)Alkoxy substituiert ist, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Cyclo-(C₃-C₇)alkyl, Amino(C₁-C₆)alkyl, Di(C₁-C₆)alkyl-amino-(C₁-C₆)alkyl, Dicarboxy-(C₁-C₄)alkyl, R¹¹-O-CO-(C₁-C₄)alkyl, das im (C₁-C₄)Alkylteil durch Amino substituiert sein kann, R¹²-S-CO-(C₁-C₄)alkyl, R⁶R⁷N-CO-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₈)-Alkanoyl, Benzoyl, Phenyl oder Benzyl, wobei die drei letztgenannten Reste gegebenenfalls ein oder zweifach durch Halogen oder eine Carboxygruppe substituiert sein können, Furfuryl oder einen fünf- oder sechsgliedrigen, gegebenenfalls benzo-kondensierten Ring mit 1-3 Heteroatomen aus der Gruppe O, S und N, bevorzugt Pyridyl, wobei der Heterocyclus durch Halogen substituiert sein kann mit der Maßgabe, daß für R⁵ = (C₁-C₈)Alkanoyl oder Benzoyl m = 0 sein muß,

R⁶ Wasserstoff, (C₁-C₈)Alkyl, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Phenyl,

25 R⁷ Wasserstoff, (C₁-C₈)Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Phenyl, Hydroxy, (C₁-C₆)Alkoxy, Cyano, Carboxy, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl substituiert ist, Amino, Di(C₁-C₄)alkylamino, (C₁-C₄)-Alkyl[phenyl-(C₁-C₂)alkyl]-amino, (C₁-C₈)-Alkylidenamino, Cyclo(C₅-C₁₂)alkylidenamino, Benzylidenamino, wobei der letztgenannte Rest im Phenylkern durch Halogen, Cyano oder Phenoxy substituiert sein kann, oder

35 R⁶ und R⁷

zusammen mit dem N-Atom, das die beiden Reste

- trägt, einen Piperidinring oder Morpholinring, die gegebenenfalls durch (C₁-C₄)Alkyl substituiert sein können, insbesondere 3,5-Dimethylpiperidinyl und 3,5-Dimethylmorpholinyl, sowie einen Piperazinring, der in Position 4 durch (C₂-C₄)Alkanoyl, (C₁-C₄)Alkyl, Phenyl oder Benzyl substituiert ist, wobei die beiden letztgenannten Reste durch Halogen oder CF₃ substituiert sein können,
- 5
- 10 R⁸, R⁹ unabhängig voneinander (C₁-C₃)Alkanoyl, Benzoyl, (C₁-C₃)Alkoxycarbonyl oder Cyano,
- R¹⁰ (C₁-C₄)Alkyl,
- 15 R¹¹ H, (C₁-C₁₈)Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Halogen, vorzugsweise Fluor, Chlor, oder Brom, Hydroxy, (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₆)Alkoxy-(C₂-C₆)alkoxy, (C₁-C₄)Alkylamino, Di(C₁-C₄)alkylamino, Phenyl oder (C₁-C₄)Alkoxy-
- 20 carbonyl substituiert ist, Cyclo(C₃-C₇)alkyl, (C₃-C₆)Alkenyl, Halogen(C₃-C₆)alkenyl, Cyclo-(C₅-C₆)alkenyl, (C₃-C₄)Alkinyl, das gegebenenfalls ein- oder zweifach durch (C₁-C₆)-Alkyl, Phenyl, Halogen oder (C₁-C₂)Alkoxy
- 25 substituiert ist, Phenyl, das gegebenenfalls ein- bis dreifach durch (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, Halogen, NO₂ oder CF₃ substituiert ist, Furfuryl, Tetrahydrofurfuryl oder ein Kationäquivalent einer organischen oder anorganischen Base, insbesondere
- 30 NH₄, Mono-, Di-, Tri(C₁-C₄)alkylammonium, Benzyl-tri(C₁-C₄)alkylammonium, Natrium oder Kalium,
- R¹² (C₁-C₆)Alkyl, Phenyl-(C₁-C₂)alkyl, wobei der Phenylrest ein- oder zweifach durch (C₁-C₄)Alkyl
- 35 oder Halogen substituiert sein kann, (C₃-C₆)-Alkenyl oder Phenyl, das ein- oder zweifach durch (C₁-C₄)Alkyl oder Halogen substituiert sein kann,

bedeuten, sowie deren pflanzenverträgliche Metall-
salzkomplexe, Säureadditionsverbindungen und
Quaternisierungsprodukte.

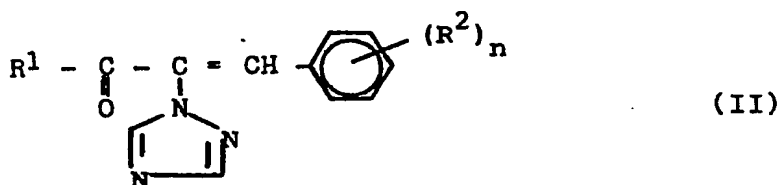
Die Reste Halogenphenoxy, Halogenphenyl, Halogenphenylalkyl enthalten
bevorzugt 1 bis drei Halogenatome, insbesondere Fluor oder Chlor.

Bevorzugt von den Definitionen für den Rest R^2 sind
Halogen, insbesondere Fluor und Chlor, Halogen(C_1-C_4)-
alkyl, insbesondere CF_3 , Halogen(C_1-C_4)alkoxy, insbeson-
dere fluoriertes Alkoxy, besonders bevorzugt OCF_2CF_2H und
 OCF_3 , und (C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl, insbesondere $-CO_2CH_3$.

Weiterhin werden solche Verbindungen der Formel (I) bevor-
zugt, bei denen X für SR^5 , NR^6R^7 oder Triazol steht.

Die Verbindungen der Formel (I) besitzen zwei asymmetri-
sche Kohlenstoffzentren; sie können deshalb in Form ihrer
reinen Stereoisomeren oder als Stereoisomerengemische
vorliegen; diese werden alle von vorliegender Erfindung
erfaßt.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist ferner ein Ver-
fahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I),
sowie deren Metallsalzkomplexe, Säureadditionsverbin-
dungen und Quaternisierungsprodukte, bei dem man eine Ver-
bindung der Formel (II)



mit einer Verbindung der Formel (III)



worin X' die für X genannten Reste mit Ausnahme von
-SOR⁵ und SO₂R⁵ bedeutet, umgesetzt, die erhaltenen Ver-
bindungen der Formel (I), worin A eine Carbonylgruppe be-
deutet, gegebenenfalls zu Verbindungen der Formel (I),
5 worin A die Gruppe -CH(OH)- bedeutet, reduziert, die
erhaltenen Verbindungen der Formel (I) im Falle X = SR⁵
gegebenenfalls zu Verbindungen der Formel (I) mit X = SOR⁵
oder SO₂R⁵ oxidiert und die Verbindungen der Formel (I)
gegebenenfalls in ein Säureadditionssalz, Komplexsalz
10 oder Quaternisierungsprodukt überführt.

Die Vinyltriazol-Derivate der Formel (II) sind teil-
weise bekannt (vgl. JP-A 53 130 661; DE-A 28 38 847,
DE-A 30 10 560, DE-A 29 29 602 und DE-A 30 00 643). Sie
15 können nach den dort angegebenen Verfahren erhalten wer-
den, in dem man beispielsweise Ketone mit Benzaldehyden
in üblicher Weise in Gegenwart eines inerten organischen
Lösungsmittels, wie beispielsweise Toluol, und in Gegen-
wart eines Katalysators, wie beispielsweise Piperidin-
20 acetat, bei Temperaturen zwischen 20° und 160°C,
insbesondere bei der Siedetemperatur des jeweiligen
Lösungsmittels, umgesetzt.

Die Vinyltriazol-Derivate der Formel (II) kommen in den
25 geometrischen Isomeren E (trans) und Z (cis) vor. Sie
können sowohl als E/Z-Isomerengemisch als auch in Form
der reinen Isomeren eingesetzt werden.

Die Verbindungen der Formel (III) sind allgemein bekannt;
30 von diesen seien beispielsweise genannt:
Ethylmercaptan, Methylmercaptan, 2-Aminoethylmercaptan,
Thioglykolsäure, Thioäpfelsäure, Cystein, Thioessigsäure,
Thiobenzoessäure, 2-Hydroxy-ethylmercaptan, 2,3-Dihydroxy-
propylmercaptan, Thiophenol, 4-Chlorbenzylmercaptan,
35 Thiosalicylsäure, Furfurylmercaptan, 2-Mercaptobenz-

thiazol, 6-Chlor-2-mercaptobenzoxazol, 2-Mercapto-
triazol, 2-Mercaptopyridin, 2-Mercaptopyrimidin,
2-Mercaptothiazolin, Propylamin, Cyanmethylamin,
2-Phenylethylamin, 2-Methoxy-ethylamin, Methylhydrazin,
5 Dimethylhydrazin, Cyclohexylidenmethylhydrazin, Piperi-
din, Morpholin, 1-Acetyl-piperazin, 1-(3-Trifluormethyl-
phenyl)-piperazin, 1-Benzylpiperazin, Acetylaceton,
Dibenzoylmethan, Benzoylaceton, Malonsäurediethylester,
Cyanessigsäureethylester.

10

Die Umsetzungen der Verbindungen der Formel (II) mit Ver-
bindungen der Formel (III) werden in der Regel in Gegenwart
eines inerten organischen Lösungsmittels durchgeführt.
Geeignet sind beispielsweise Ketone, vorzugsweise Aceton
15 und Methylethylketon, Alkohole, vorzugsweise Methanol,
Ethanol und Isopropanol, Nitrile, vorzugsweise Aceto-
nitril und Propionitril, aromatische Kohlenwasserstoffe,
vorzugsweise Benzol, Toluol oder Xylol sowie Ether, vor-
zugsweise Diethylether oder Tetrahydrofuran.

20

Ferner kann bei dieser Reaktion als Katalysator eine Base
zugesetzt werden. Hierfür kommen in Frage: Alkalimetall-
alkoholate, wie Natrium- oder Kaliummetholat oder
-ethylat, Alkalimetallamide, wie Natrium- oder Kalium-
25 amid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid sowie vor-
zugsweise tertiäre organische Amine, wie Trialkylamine,
insbesondere Triethylamin, Pyridin oder Diazabicyclo-
octan.

30

Die Reaktionstemperaturen können in einem größeren Be-
reich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man
zwischen 0° und 120°C, vorzugsweise bei 20° bis 80°C.

35

Für die Reduktion der Verbindungen der Formel (I), worin A
eine Carbonylgruppe bedeutet, eignen sich als Reduktions-

mittel bevorzugt komplexe Hydride, insbesondere Natrium-
borhydrid. Man arbeitet in Gegenwart eines Lösungs-
mittels, insbesondere eines Alkohols, vorzugsweise
Methanol, bei Temperaturen zwischen 0° und 100°C, vor-
zugsweise 25° bis 60°C.

Die Oxidation der Verbindungen der Formel (I) mit $X = SR^5$
erfolgt mit üblichen Oxidationsmitteln wie H_2O_2 , Peressig-
säure, m-Chlorperbenzoesäure, Perjodsäure, Chromsäure,
Kaliumpermanganat nach bekannten üblichen Methoden.

Die neuen Azolylalkyllderivate sind als basische Ver-
bindungen zur Bildung von Salzen, Komplexsalzen und
Quaternisierungsprodukten befähigt. Genannt seien Salze
mit organischen und anorganischen Säuren, wie Acetate,
Fumarate, Oxalate, Benzoate, Phenolate, Nitrate, Bromide,
Chloride, Sulfate, Sulfonate, Komplexe mit Metallen der
Gruppe Ib, IIb, IVb oder VIII des Periodensystems, insbe-
sondere mit Kupfer, Zink, Zinn und Nickel sowie Quaterni-
sierungsprodukte mit (C_1-C_6) Alkyl- und Phenacylhalogeni-
den. Die Herstellung derartiger Derivate erfolgt nach
allgemein üblichen Methoden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen besitzen intensive
pflanzenwachstumsregulierende und mikrobiozide Wirkungen.

So zeichnen sie sich durch hervorragende fungizide Wirk-
samkeit aus. Selbst in das pflanzliche Gewebe einge-
drungene pilzliche Krankheitserreger lassen sich
erfolgreich kurativ bekämpfen. Dies ist besonders wichtig
und vorteilhaft bei solchen Pilzkrankheiten, die nach
eingetretener Infektion mit den sonst üblichen Fungiziden
nicht mehr wirksam bekämpft werden können. Das Wirkungs-
spektrum der neuen Verbindungen erfaßt ferner eine Viel-
zahl verschiedener phytopathogener Pilze, wie z.B.
Piricularia oryzae, *Plasmopara viticola*, verschiedene
Rostarten, *Pellicularia sasakii*, *Venturia inaequalis* und
Cercospora beticola, vor allem aber echte Mehltaupilze im
Obst-, Gemüse-, Getreide- und Zierpflanzenbau.

Die Verbindungen der Formel (I) eignen sich ferner für den Einsatz in technischen Bereichen, beispielsweise als Holzschutzmittel, als Konservierungsmittel in Anstrichfarben, in Kühlschmiermitteln für die Metallbearbeitung oder als Konservierungsmittel in Bohr- und Schneideölen.

Die erfindungsgemäßen Substanzen weisen außerdem hervorragende wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeigenen Stoffwechsel ein und können damit zur gezielten Beeinflussung von Pflanzeninhaltsstoffen und zur Ernteerleichterung wie z.B. durch Auslösen von Desikation und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Des weiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativen Wachstum, ohne dabei die Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen mono- und dikotylen Kulturen eine große Rolle, da das Lagern hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann. Besonders hervorzuheben ist die wachstumsregulatorische Wirksamkeit der Verbindungen als Wuchshemmer in Getreide, Mais, Soja, Baumwolle, Rasen sowie ihre Fähigkeiten, den Gehalt an erwünschten Inhaltsstoffen wie Kohlehydraten und Protein bei Nutzpflanzen zu erhöhen. Schließlich zeigen die Verbindungen eine sehr gute Verbesserung der Fruchtabszission, insbesondere bei Zitrusfrüchten, oder eine Reduktion der Haltekraft.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher auch pflanzenwachstumsregulierende und fungizide Mittel, die die obengenannten Verbindungen der Formel (I) oder deren Metallsalzkomplexe, Säureadditionsverbindungen und Quaternisierungsprodukte enthalten.

Die Mittel können als Spritzpulver, emulgierbare Konzentrate, versprühbare Lösungen, Stäubemittel, Beizmittel, Dispersionen, Granulate oder Mikrogranulate in den üblichen Zubereitungen angewendet werden.

Unter Spritzpulvern werden in Wasser gleichmäßig disper-
gierbare Präparate verstanden, die neben dem Wirkstoff
außer gegebenenfalls einem Verdünnungs- oder Inertstoff
noch Netzmittel, z.B. polyoxethylierte Alkylphenole,
5 polyoxethylierte Fettalkohole, Alkyl- oder Alkylphenyl-
sulfonate und Dispergiermittel, z.B. ligninsulfonsaures
Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures
Natrium, dibutyl-naphthalinsulfonsaures Natrium oder auch
oleoylethyltaurinsäures Natrium enthalten. Ihre Her-
10 stellung erfolgt in üblicher Weise z.B. durch Mahlen und
Vermischen der Komponenten.

Emulgierbare Konzentrate können z.B. durch Auflösen des
Wirkstoffes in einem inerten organischen Lösungsmittel,
15 z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder
auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen
unter Zusatz von einem oder mehreren Emulgatoren herge-
stellt werden. Bei flüssigen Wirkstoffen kann der
Lösungsmittelanteil ganz oder auch teilweise entfallen.
20 Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden:
Alkylarylsulfonsäure Calciumsalze wie Ca-dodecylbenzol-
sulfonat, oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäure-
polyglykolester, Alkylarylpolyglykolether, Fettalkohol-
polyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensations-
25 produkte, Alkylpolyglykolether, Sorbitanfettsäureester,
Polyoxethylensorbitanfettsäureester oder Polyoxethylen-
sorbitester.

Stäubemittel werden durch Vermahlen des Wirkstoffes mit
30 fein verteilten, festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen
Tonen wie Kaolin, Bentonit, Pyrophyllit oder Diatomeener-
de erhalten.

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes
35 auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial herge-

- stellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Bindemitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von
- 5 granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise - gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - granuliert werden.
- 10 In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration etwa 10 bis 90 Gew.-%; der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 10 bis 80 Gew.-% betragen. Staubbörmige Formulierungen enthalten
- 15 meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen etwa 1 bis 20 Gew.-%. Bei Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierungsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden.
- 20 Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Lösungsmittel, Füll- oder Trägerstoffe.
- 25 Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Konzentrate gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und teilweise auch bei Mikrogranulaten
- 30 mittels Wasser. Staubbörmige und granuliert Zubereitungen sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.
- 35 Auch Mischungen oder Mischformulierungen mit anderen

Wirkstoffen, wie z.B. Insektiziden Akariziden, Herbiziden, Düngemitteln, oder weiteren Wachstumsregulatoren oder Fungiziden sind gegebenenfalls möglich.

- 5 Die benötigten Aufwandmengen der Verbindungen der Formel (I) können je nach Indikation innerhalb weiter Grenzen schwanken und variieren auch in Abhängigkeit von äußeren Bedingungen wie Bodenverhältnissen und Klimabedingungen. Im allgemeinen liegen sie jedoch zwischen 0,01 - 10 kg Wirkstoff/ha. Im Falle der Anwendung als Pflanzenwachstumsregulatoren variieren die Aufwandmengen insbesondere im Bereich zwischen 0,15 und 1,25 kg/ha, im Falle der fungiziden Anwendung insbesondere zwischen 0,15 bis 0,5 kg/ha.
- 15 Die folgenden Beispiele dienen der weiteren Erläuterung der Erfindung.

A. Formulierungsbeispiele

- 5 a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile Wirkstoff und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
- 10 b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gew.-Teile Wirkstoff, 64 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.
- 15 c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat stellt man her, indem man 20 Gew.-Teile Wirkstoff mit 6 Gew.-Teilen Alkylphenolpolyglykoether (z.B. ^(R)Triton X 207, von Rohm & Haas & Co.), 3 Gew.-Teilen Isotridecanolpolyglykoether (8 AeO) und 71
- 20 Gew.-Teilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 377°C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- 25 d) Ein emulgierbares Konzentrat läßt sich herstellen aus 15 Gewichtsteilen Wirkstoff, 75 Gewichtsteilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gewichtsteilen oxethyliertes Nonylphenol (10 AeO) als Emulgator.

B. Herstellungsbeispiele

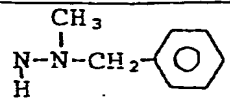
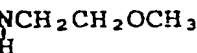
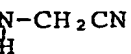
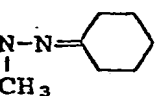
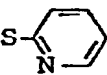
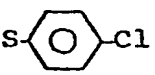

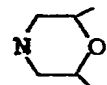

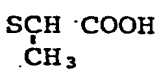
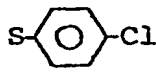
Beispiel 1


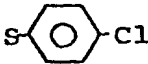
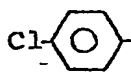

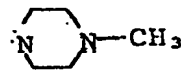
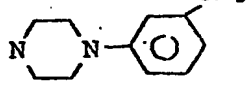

- 5 1-(4-Chlorphenyl)-1-ethylthio-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-3-pentanon


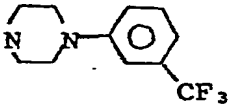


- Man suspendierte 27,7 g (0,1 mol) 1-(4-Chlorphenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on in 60 ml
10 Ethanol, setzte 0,3 ml Triethylamin zu und versetzte mit 6,2 g (0,1 mol) Ethylmercaptan. Es entstand eine klare Lösung, aus der nach kurzer Zeit farblose Kristalle ausfielen. Man rührte 2 h bei Raumtemperatur nach und
15 isolierte durch Absaugen 28,6 g (85 % d.Th.) einer farblosen Substanz vom Schmp. 143-5°C als Diastereomerenmisch.

In analoger Weise wurden die Verbindungen der nachfolgenden Tabelle I hergestellt.

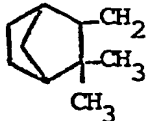
0153657

Bei- spiel	R ¹	(R ²) _n	X'	A	Smp (°C)
15	(CH ₃) ₂ CH-	4-Cl		CO	Oel
16	"	"		"	98-9
17	"	"		"	141-2
18	"	"		"	Oel
19	"	"	NHC ₃ H ₇	"	94-6
20	"	"	SCH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	"	Oel
21	"	"		"	137-9
22	"	3-OCF ₂ CF ₂ H		"	129-30
23	"	2,4-Cl ₂		"	129-30
24	"	"		"	amorph
25	"	"		"	Oel
26	"	"	NN(CH ₃) ₂	"	142 (Zers.)
27	"	"	SCH ₂ CHOHCH ₂ OH	"	Oel
28	"	4-Cl		"	128-9
29	i-C ₄ H ₉	"		"	131-2

Bei- spiel	R ¹	(R ²) _n	X ¹	A	Smp (°C)
30	i-C ₄ H ₉	4-Cl	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	CO	Oel
31	"	"	SCH ₂ CHOHCH ₂ OH	"	138
32	"	2,4-Cl ₂	S- 	"	Oel
33	"	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	"
34	"	2-CO ₂ CH ₃	SCH ₂ CHOHCH ₂ OH	"	"
35	"	"	S- 	"	"
36	Cl- 	4-Cl	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	116-9
37	CH ₃	2-CO ₂ CH ₃	S- 	"	Oel
38	"	"	N-NH ₂ CH ₃	"	1145
39	"	4-Cl	SC ₂ H ₅	"	Oel
40	i-C ₃ H ₇	2,4-Cl ₂	SCH ₂ CH ₂ NH ₂	"	175-86
41	"	"		"	112-4
42	"	4-Cl		"	112-3
43	"	"	SC ₂ H ₅	"	143-5
44	"	"	SC(CH ₃) ₃	"	183-4
45	"	"	SCOCH ₃	"	158-60
46	"	"	SCH ₂ - 	"	122-3
47	i-C ₃ H ₇	"	SCHCOOH CH ₃	"	128-9

Bei- spiel	R ¹	(R ²) _n	X'	A	Smp (°C)
48	i-C ₃ H ₇	4-Cl	$\text{S}-\underset{\text{COOH}}{\text{CH}}\text{CH}_2\text{COOH}$	CO	196-8
49	"	"	$\text{SCH}_2\underset{\text{NH}_2}{\text{CH}}\text{COOH}$	"	166-7
50	"	"	$\text{S}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OH}$	"	203-6
51	"	2,4-Cl ₂	SC ₂ H ₅	"	Oel
52	i-C ₄ H ₉	"	S-C(CH ₃) ₃	"	140-1
53		H		"	137-8
54	"	4-Cl	SCOCH ₃	"	174-6
55	"	"	SCO- 	"	130-2
56	"	"	SCH(CH ₃) ₂	"	157-9
57	"	"	$\text{S}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{HOOC}$	"	168-70
58	"	"	SC ₂ H ₅	"	147-8
59	"	2,4-Cl ₂	"	"	133-4
60	Cl	4-Cl	$\text{S}-\underset{\text{COOH}}{\text{CH}}-\text{CH}_2\text{COOH}$	"	201-2
61	"	2-CO ₂ CH ₃	$\text{SCH}_2\underset{\text{OH}}{\underset{\text{OH}}{\text{CH}}}\text{CH}_2$	"	Oel
62	"	"	$\text{NN}(\text{CH}_3)_2$ H	"	"
63	i-C ₃ H ₇	4-Cl	SC ₂ H ₅	CH(OH)	"
64		2,4-Cl ₂	"	"	"

Bel- spiel	R ¹	(R ²) _n	X'	A	Smp. °C
65	CH ₃	4-Cl	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	CO	Öl
66	"	"	SCH ₂ CO ₂ C ₃ H ₇ (1)	"	Öl
67	"	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₂ CH(C ₂ H ₅) ₂	"	Öl
68	"	"	SCH ₂ CH ₂ OH	"	Öl
69	"	"	SCH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	"	Öl
70	"	"	NH-C ₃ H ₇	"	Öl
71	C ₂ H ₅	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	Öl
72	"	"	SCH ₂ CO ₂ C ₆ H ₁₃	"	Öl
73	"	"	SCH(CH ₃)CO ₂ CH ₃	"	Öl
74	"	"	SCH ₂ CH ₂ OH	"	Öl
75	"	"	SCH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	"	Öl
76	"	"	S-C ₆ H ₄ -4-Cl	"	137-8
77	(CH ₃) ₂ CH	"	SCH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	"	103-5
78	"	"	SCH ₂ CO ₂ C ₃ H ₇ (1)	"	99-102
79	"	"	SCH ₂ CO ₂ -C ₆ H ₁₁ (cyclo)	"	105
80	"	"	SCH ₂ CO ₂ C ₆ H ₁₃	"	97-9
81	"	"	SCH ₂ CO ₂ C ₁₂ H ₂₅	"	44-6
82	"	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₂ CH(C ₂ H ₅) ₂	"	65-70
83	"	"	"	CH(OH)	Öl
84	"	"	SCH(CH ₃)CO ₂ CH ₃	CO	76-80
85	"	"	SCH(CH ₃)CO ₂ C ₂ H ₅	"	Öl
86	"	"	SCH(CH ₃)CO ₂ C ₃ H ₇ (1)	"	Öl
87	"	"	SCH(CH ₃)CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	"	Öl
88	"	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	"	Öl
89	"	4-Cl	SCH ₂ CH ₂ OH	"	139-40
90	"	"	S-C ₆ H ₁₁ (cyclo)	"	111-3
91	"	"	S-CH(CH ₃)C ₂ H ₅	"	108-13
92	"	4-F	S-C ₆ H ₄ -4-Cl	"	149-50

grel- spiel	R ¹	(R ²) _n	X'	A	Smp. °C
93	(CH ₃) ₂ CH	4-F	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	CO	101-2
94	"	"	SCH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	"	116-7
95	"	4-OC ₂ H ₅	S CH ₂ CO ₂ CH ₃	"	öl
96	"	"	S-C ₆ H ₄ -4-Cl	"	92-3
97	"	4-CO ₂ CH ₃	"	"	142-4
98	"	"	SCH(CH ₃)CO ₂ C ₂ H ₅	"	öl
99	"	3-Br	S-C ₆ H ₄ -4-Cl	"	132-4
100	"	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	öl
101	"	"	SCH(CH ₃)CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	"	öl
102	"	"	SCH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	"	öl
103	"	2-Cl	"	"	öl
104	"	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	öl
105	"	"	SCH(CH ₃)CO ₂ C ₃ H ₇ (1)	"	öl
106	"	2-OCH ₃	S-C ₆ H ₄ -4-Cl	"	59-61
107	"	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	öl
108	"	"	SCH ₂ CO ₂ C ₆ H ₁₃	"	öl
109	"	"	SCH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	"	öl
110	"	H	S-C ₆ H ₄ -4-Cl	"	130-2
111	"	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	113-5
112	"	"	SCH(CH ₃)CO ₂ C ₃ H ₇ (1)	"	öl
113	"	"	SCH ₂ CH ₂ OH	"	144-6
114	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	3-Cl	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	öl
115	"	"	SCH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	"	öl
116		4-Cl	S-C ₆ H ₄ -4-Cl	"	öl
117	"	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	öl
118	CH ₃ OC(=O)CH ₂ CH ₂	"	S-C ₆ H ₄ -4-Cl	"	87-8
119	"	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	öl

Bei- spiel	R ¹	(R ²) _n	X'	A	Smp. °C
120	(4)Cl-C ₆ H ₄ - $\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{C}-\text{CH}_2 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	Öl
121	"	"	SCH ₂ CH ₂ OH	"	132-4
122	C ₆ H ₅	"	"	"	146-7
123	"	"	NH-N(CH ₃) ₂	"	Öl
124	"	"	SCH ₂ CO ₂ CH ₃	"	109-11
125	"	"	SCH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	"	106-8
126	"	"	SCH ₂ CO ₂ C ₆ H ₁₃	"	Öl
127	"	"	S-C ₆ H ₅	"	149-51
129	"	"	"	CH(OH)	164-7

C. Biologische Beispiele

Beispiel 1

5 Weizenpflanzen wurden im 3-Blattstadium mit Konidien
des Weizenmehltaus (*Erysiphe graminis*) stark inokuliert
und in einem Gewächshaus bei 20 °C und einer relativen
Luftfeuchte von 90 - 95 % aufgestellt. 3 Tage nach
10 Inokulation wurden die Pflanzen mit den zu prüfenden
Verbindungen in den Wirkstoffkonzentrationen von 500,
250 und 125 mg/Liter Spritzbrühe tropfnaß gespritzt.
Nach einer Inkubationszeit von 10 Tagen untersuchte man
die Pflanzen auf Befall mit Weizenmehltau.

15 Der Befallsgrad wird ausgedrückt in % befallener Blatt-
fläche, bezogen auf unbehandelte, infizierte Kontroll-
pflanzen (= 100 % Befall). Die Ergebnisse zeigt die
nachstehende Tabelle II.

20 Tabelle II

Verb. gem. Bei- spiel	mit Weizenmehltau befallene Blattfläche in % bei mg ... Wirkstoff/Liter Spritzbrühe			
	500	250	125	
25	2	0	0	0
	3	0	0	0
	5	0	0	0
	6	0	0	0
30	9	0	0	0
	10	0	0	0
	11	0	0	0
	12	0	0	0
35	15	0	0	0
	16	0	0	0
	18	0	0	0
	19	0	0	0

Fortsetzung Tabelle II

Verb. gem. Bei- spiel	mit Weizenmehltau befallene Blattfläche in % bei ... mg Wirkstoff/Liter Spritzbrühe		
	500	250	125
20	0	0	0
21	0	0	0
23	0	0	0
24	0	0	0
25	0	0	0
26	0	0	0
27	0	0	0
30	0	0	0
31	0	0	0
32	0	0	0
unbehandelte, infizierte Pflanzen	100		

Beispiel 2

Gerstenpflanzen wurden im 3-Blattstadium mit Konidien des Gerstenmehltaus (*Erysiphe graminis* sp. *hordei*) stark inokuliert und in einem Gewächshaus bei 20 °C und einer relativen Luftfeuchte von 90 bis 95 % aufgestellt. 3 Tage nach Inokulation wurden die Pflanzen mit den zu prüfenden Verbindungen in den Wirkstoffkonzentrationen von 500, 250 und 125 mg/Liter Spritzbrühe tropfnaß gespritzt. Nach einer Inkubationszeit von 10 Tagen wurde der Befall mit Gerstenmehltau untersucht. Der Befallsgrad wird ausgedrückt in % befallener Blattfläche, bezogen auf unbehandelte, infizierte Kontrollpflanzen (= 100 % Befall). Die Ergebnisse zeigt Tabelle III.

...

Tabelle III

	Verbindung gemäß Beispiel	mit Gerstenmehltau befallene Blattfläche in % bei ... mg Wirkstoff/Liter Spritz- brühe		
		500	250	125
5	5	0	0	0 - 3
	7	0	0	0
	11	0	0	0
10	12	0	0	0
	15	0	0	0
	18	0	0	0
	19	0	0	0
	20	0	0	0
15	21	0	0	0
	23	0	0	0
	24	0	0	0
	25	0	0	0
	26	0	0	0
20	27	0	0	0
	30	0	0	0
	31	0	0	0
	32	0	0	0
	33	0	0	0
25	34	0	0	0
	unbehan- delte, infi- zierte Pflanzen	100		
30				

Beispiel 3

Gurkenpflanzen (Sorte Delikateß) wurden im 2-Blattstadium mit einer Konidiensuspension von Gurkenmehltau (*Erysiphe cichoracearum*) stark inokuliert. Nach einer Antrocknungszeit der Sporensuspension von 30 Minuten wurden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 22 °C und 90 % relativer Luftfeuchte aufgestellt. 3 Tage nach Infektion wurde mit den zu prüfenden Verbindungen in den in Tabelle IV angegebenen Wirkstoffkonzentrationen tropfnaß gespritzt. Nach 10 Tagen erfolgte die Bonitur. Der Befallsgrad wird ausgedrückt in % befallener Blattfläche, bezogen auf unbehandelte, infizierte Kontrollpflanzen (= 100 % Befall). Tabelle IV zeigt die Ergebnisse.

Tabelle IV

Verbindung gemäß Beispiel	mit Gurkenmehltau befallene Blattfläche in % bei ... mg Wirkstoff/Liter Spritzbrühe		
	500	250	125
5	0	0	0
6	0	0	0
10	0	0	0
12	0	0	0
15	0	0	0
18	0	0	0
19	0	0	0
20	0	0	0
21	0	0	0
23	0	0	0
25	0	0	0
26	0	0	0
27	0	0	0
29	0	0	0
...			

Fortsetzung Tabelle IV

Verbindung gemäß Beispiel	mit Gurkenmehltau befallene Blattfläche in % bei ... mg Wirkstoff/Liter Spritz- brühe		
	500	250	125
31	0	0	0
32	0	0	0
33	0	0	0
34	0	0	0
35	0	0	0
unbehandelte, infizierte Pflanzen	100		

Beispiel 4

Wuchshemmung an Getreide

In Schalenversuchen im Gewächshaus wurden junge Getreidepflanzen (Weizen, Gerste und Roggen) im 3-Blattstadium mit den in Tabelle I genannten Verbindungen in den angegebenen Wirkstoffkonzentrationen (kg/ha) tropfnaß gespritzt.

Nachdem die unbehandelten Kontrollpflanzen eine Wuchshöhe von etwa 55 cm erreicht hatten, wurde bei allen Pflanzen der Zuwachs gemessen und die Wuchshemmung in % des Zuwachses der Kontrollpflanzen berechnet. Es wurde außerdem die phytotoxische Wirkung der Verbindungen beobachtet. Die Ergebnisse sind in der Tabelle V zusammengefaßt. Bei der Angabe der Wuchshemmung bedeuten 100 % den Stillstand des Wachstums und 0 % ein Wachstum entsprechend dem der unbehandelten Kontrollpflanzen.

...

Tabelle V

Verbin- dung gem. Bsp.	Anwen- dungs- konz. (kg/ha)	Wuchshemmung in %			phytotox. Wirkung
		Weizen	Gerste	Roggen	
5	2,5	21	24	40	keine Schäden
	1,25	21	24	40	
10	2,5	18	22	36	keine Schäden
	1,25	16	22	26	
15	2,5	19	30	39	keine Schäden
	1,25	12	13	36	
20	2,5	25	23	37	keine Schäden
	1,25	24	22	35	
25	2,5	19	19	29	keine Schäden
	1,25	17	16	27	
30	2,5	24	23	34	keine Schäden
	1,25	23	22	34	

Beispiel 5

Wuchshemmung in Wasserreis

Reispflanzen wurden in Kleinparzellen (2 m x 2 m) ange-
zogen und im Stadium der maximalen Bestockung mit den
angegebenen Verbindungen behandelt. Die Substanzen kön-
nen sowohl durch Spritzung appliziert als auch in das
Wasser gegeben werden.

3 Wochen nach Behandlung wurde bei allen Pflanzen der
Zuwachs gemessen und die Wuchshemmung in % des Zu-
wachses der Kontrollpflanzen berechnet. Es wurde außer-

...

0153657

demauf eine mögliche phytotoxische Wirkung der Verbindungen geachtet.

Die Ergebnisse sind in Tabelle VI zusammengefaßt. Bei der Angabe der Wuchshemmung bedeuten 100 % den Stillstand des Wachstums und 0 % ein Wachstum entsprechend der Kontrolle.

Tabelle VI

Verbindung gem. Bsp.	Anwendungskonz. (kg/ha)	Wuchshemmung (%)	Phytotox. Wirkung
5	1,25	22	keine Schäden
	0,62	19	
7	1,25	20	keine Schäden
	0,62	17	
8	1,25	21	keine Schäden
	0,62	17	
11	1,25	22	keine Schäden
	0,62	16	
18	1,25	21	keine Schäden
	0,62	18	
19	1,25	21	keine Schäden
	0,62	19	

Beispiel 6

Wuchshemmung an Sojabohnen

Ca. 10 cm große Sojabohnen wurden mit den Wirkstoffzubereitungen tropfnaß bespritzt. Nach 3 Wochen wird der Zuwachs gemessen und die Wuchshemmung in % des Zu-

...

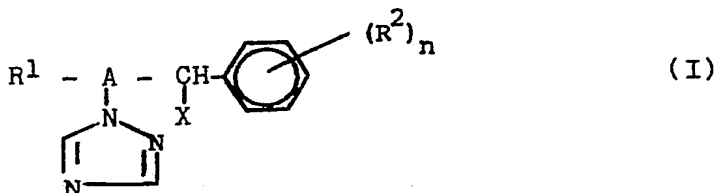
wachses der Kontrollpflanzen berechnet. Die Ergebnisse sind in Tabelle VII zusammengefaßt.

Tabelle VII

Verbindung gem. Bsp.	Anwendungs- konz. (kg/ha)	Wuchshemmung (%)	Phytotox. Wirkung
5	2,5	68	keine Schäden
	1,25	68	
	0,62	52	
7	2,5	55	keine Schäden
	1,25	55	
	0,62	49	
8	2,5	65	keine Schäden
	1,25	55	
	0,62	53	
19	2,5	62	keine Schäden
	1,25	58	
	0,62	56	

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel (I)



10 worin

A eine Carbonylgruppe oder die Gruppierung -CH(OH)-

R¹ Phenyl das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Halogen, Trifluormethyl, NO₂, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkyl und/oder einfach durch Phenyl, Phenoxy oder Halogenphenoxy substituiert ist gegebenenfalls durch (C₁-C₄)Alkyl substituiertes Cyclo(C₃-C₇)alkyl oder Bicyclo(C₆-C₁₄)alkyl insbesondere [2.2.1]Bicycloheptyl, oder die

20 Gruppierung -CHR³R⁴, in welcher

R³ Wasserstoff oder (C₁-C₄)Alkyl, insbesondere Methyl,

R⁴ Wasserstoff, (C₁-C₃)Alkyl, insbesondere Methyl, Halogen(C₁-C₄)alkyl, Cyclo(C₃-C₆)alkyl, Bicyclo(C₆-C₁₄)alkyl, insbesondere /2.2.1/-Bicycloheptyl,

25 das durch (C₁-C₄)alkyl ein oder mehrfach substituiert sein kann, Phenyl, Halogenphenyl, Phenyl-

(C₁-C₄)alkyl, Halogenphenyl-(C₁-C₄)alkyl oder (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl,

R² Halogen, Halogen(C₁-C₄)alkyl oder Halogen(C₁-C₄)-

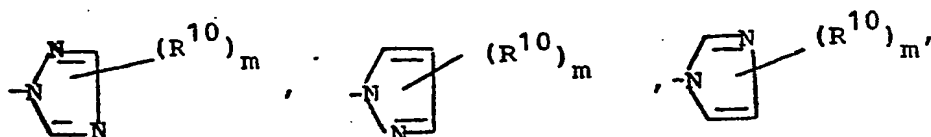
30 alkoxy mit jeweils bis zu 5 Halogen, insbesondere Fluor oder Chlor, (C₁-C₆)Alkyl,

Cyclo(C₅-C₇)alkyl, (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₆)-

Alkylthio, (C₂-C₆)Alkenyloxy, Di(C₁-C₆)alkyl-
amino, Nitro, Cyano, Hydroxy, (C₁-C₄)Alkoxy-
carbonyl, Phenyl, Phenoxy oder im Falle n = 2
können zwei Reste R² zusammen eine gegebenenfalls
ungesättigte Kohlenwasserstoffkette mit 3 bis 4 C-
Atomen bilden, die benachbarte Ringpositionen mit-
einander verbinden,

n 0, 1, 2 oder 3, wobei bei Mehrfachsubstitution die
Reste R₂ verschiedene Bedeutungen besitzen können,

10 X -S(O)_mR⁵; -NR⁶R⁷, CHR⁸R⁹,



15

wobei

m 0, 1 oder 2

R⁵ (C₁-C₁₂)Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach
durch Hydroxy, Halogen oder (C₁-C₄)Alkoxy substi-
tuiert ist, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkynyl, Cyclo-
20 (C₃-C₇)alkyl, Amino(C₁-C₆)alkyl, Di(C₁-C₆)alkyl-
amino-(C₁-C₆)alkyl, Dicarboxy-(C₁-C₄)alkyl,
R¹¹-O-CO-(C₁-C₄)alkyl, das im (C₁-C₄)Alkylteil
durch Amino substituiert sein kann, R¹²-S-CO-
25 (C₁-C₄)Alkyl, R⁶R⁷N-CO-(C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₈)-
Alkanoyl, Benzoyl, Phenyl oder Benzyl, wobei die
drei letztgenannten Reste gegebenenfalls ein oder
zweifach durch Halogen oder eine Carboxygruppe sub-
stituiert sein können, Furfuryl oder einen fünf-
30 oder sechsgliedrigen, gegebenenfalls benzo-
kondensierten Ring mit 1-3 Heteroatomen aus der
Gruppe O, S und N, wobei der Heterocyclus durch Ha-
logen substituiert sein kann, bevorzugt Pyridyl,
mit der Maßgabe, daß für R⁵ = (C₁-C₈)Alkanoyl oder
35 Benzoyl m = 0 sein muß,

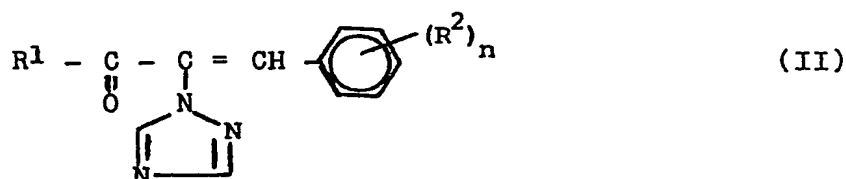
- R⁶ Wasserstoff, (C₁-C₈)Alkyl, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Phenyl,
- 5 R⁷ Wasserstoff, (C₁-C₈)Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Phenyl, Hydroxy, (C₁-C₆)Alkoxy, Cyano, Carboxy, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl substituiert ist, Amino, Di(C₁-C₄)alkylamino, (C₁-C₄)-Alkyl[phenyl-(C₁-C₂)alkyl]-amino, (C₁-C₈)-Alkylidenamino, Cyclo(C₅-C₁₂)alkylidenamino, 10 Benzylidenamino, wobei der letztgenannte Rest im Phenylkern durch Halogen, Cyano oder Phenoxy substituiert sein kann, oder
- R⁶ und R⁷
- 15 zusammen mit dem N-Atom, das die beiden Reste trägt, einen Piperidinring oder Morpholinring, die gegebenenfalls durch (C₁-C₄)Alkyl substituiert sein können, insbesondere 3,5-Dimethylpiperidinyl und 3,5-Dimethylmorpholinyl, sowie einen Piperazinring,
- 20 der in Position 4 durch (C₂-C₄)Alkanoyl, (C₁-C₄)Alkyl, Phenyl oder Benzyl substituiert ist, wobei die beiden letztgenannten Reste durch Halogen oder CF₃ substituiert sein können,
- 25 R⁸, R⁹ unabhängig voneinander (C₁-C₃)Alkanoyl, Benzoyl, (C₁-C₃)Alkoxy-carbonyl oder Cyano,
- R¹⁰ (C₁-C₄)Alkyl,
- 30 R¹¹ H, (C₁-C₁₈)Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Halogen, vorzugsweise Fluor, Chlor, oder Brom, Hydroxy, (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₆)Alkoxy-(C₂-C₆)alkoxy, (C₁-C₄)Alkylamino, Di(C₁-C₄)alkylamino, Phenyl oder (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl substituiert ist, Cyclo(C₃-C₇)alkyl,
- 35

(C₃-C₆)Alkenyl, Halogen(C₃-C₆)alkenyl, Cyclo-
(C₅-C₆)alkenyl, (C₃-C₄)Alkynyl, das ge-
gebenenfalls ein- oder zweifach durch (C₁-C₆)-
Alkyl, Phenyl, Halogen oder (C₁-C₂)Alkoxy
substituiert ist, Phenyl, das gegebenenfalls ein-
bis dreifach durch (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy,
Halogen, NO₂ oder CF₃ substituiert ist, Furfuryl,
Tetrahydrofurfuryl oder ein Kationäquivalent einer
organischen oder anorganischen Base, insbesondere
NH₄, Mono-, Di-, Tri(C₁-C₄)alkylammonium, Benzyl-
tri(C₁-C₄)alkylammonium, Natrium oder Kalium,

R¹² (C₁-C₆)Alkyl, Phenyl-(C₁-C₂)alkyl, wobei der
Phenylrest ein- oder zweifach durch (C₁-C₄)Alkyl
oder Halogen substituiert sein kann, (C₃-C₆)-
Alkenyl oder Phenyl, das ein- oder zweifach durch
(C₁-C₄)Alkyl oder Halogen substituiert sein kann,

bedeuten, sowie deren pflanzenverträgliche Metall-
salzkomplexe, Säureadditionsverbindungen und
Quaternisierungsprodukte.

2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen gemäß An-
spruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbin-
dung der Formel (II)



mit einer Verbindung der Formel (III),

H-X'

(III)

- 5 worin X' die für X genannten Reste mit Ausnahme von
-SOR⁵ und -SO₂R⁵ bedeutet, umgesetzt, die erhaltenen
Verbindungen der Formel (I), worin A eine Carbonylgruppe
bedeutet, gegebenenfalls reduziert, die erhaltenen
Verbindungen der Formel (I) im Falle X = SR⁵ gegebenen-
falls zu Verbindungen der Formel (I) mit X = SOR⁵ oder
10 SO₂R⁵ oxidiert und die Verbindungen der Formel I ge-
gebenenfalls in ein Säureadditionssalz, Komplexsalz
oder Quaternisierungsprodukt überführt.
- 15 3. Pflanzenwuchsregulierende und fungizide Mittel, ge-
kennzeichnet durch einen wirksamen Gehalt an einer
Verbindung gemäß Anspruch 1.
4. Verwendung von Verbindungen gemäß Anspruch 1 als
Fungizide oder Wachstumsregulatoren.
- 20 5. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch ge-
kennzeichnet, daß man auf die zu schützenden Pflanzen,
Pflanzenteile oder Anbauflächen eine Verbindung gemäß
Anspruch 1 aufbringt.
- 25 6. Verfahren zur Wachstumsregulierung von Kulturpflanzen,
dadurch gekennzeichnet, daß man auf die zu schützenden
Pflanzen, Pflanzenteile oder Anbauflächen eine Verbin-
dung gemäß Anspruch 1 aufbringt.



Europäisches
Patentamt

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

0153657

Nummer der Anmeldung

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			EP 85101520.6		
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl. 4)		
D, A	EP - A2 - 0 092 730 (BASF) * Formel I * --	1, 3	C 07 D 249/08 C 07 D 401/06 C 07 D 401/12 C 07 D 403/06 C 07 D 405/12 A 01 N 43/653		
D, A	EP - A1 - 0 059 894 (BAYER) * Zusammenfassung *	1, 3			
A	DE - A1 - 2 604 308 (BAYER) * Formel I * --	1, 4			
A	DE - A1 - 3 151 440 (BAYER) * Anspruch 1 *	1			
A	DE - A1 - 3 139-250 (BASF) * Zusammenfassung *	1, 3			
A	DE - A1 - 3 200 414 (BAYER) * Formel I * --	1, 3, 4			
A	EP - A1 - 0 068 144 (HOECHST) * Formel I * ----	1, 4			
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt.					
Recherchenort WIEN		Abschlußdatum der Recherche 30-04-1985	Prüfer HAMMER		
<table border="0"><tr><td>KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : mündliche Offenbarung P : Zwischenliteratur T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze</td><td>E : älteres Patentedokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus andern Gründen angeführtes Dokument & : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument</td></tr></table>				KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : mündliche Offenbarung P : Zwischenliteratur T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze	E : älteres Patentedokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus andern Gründen angeführtes Dokument & : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument
KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : mündliche Offenbarung P : Zwischenliteratur T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze	E : älteres Patentedokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus andern Gründen angeführtes Dokument & : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument				

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.